

処方箋医薬品*

貯法	室温、遮光保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

日本薬局方 スルピリン注射液

メチロン[®]注25%

METILON[®] INJECTION

日本標準商品分類番号

871144

承認番号16100AMZ01083

薬価収載1950年9月

販売開始1947年11月

再評価結果1976年7月

※注意—医師等の処方箋により使用すること

【 警 告 】

ショック等の重篤な副作用が発現することがあるので、
効能・効果、使用上の注意に特に留意すること。

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

1. 本剤の成分又はピラゾロン系化合物に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 先天性G-6PD欠乏症の患者[海外で溶血性貧血が発現したとの報告がある。]
3. 消化性潰瘍のある患者[PG合成抑制により胃の血流量が減少し、消化性潰瘍が悪化することがある。]
4. 重篤な血液の異常のある患者[血液障害(再生不良性貧血、無顆粒球症等)があらわれるおそれがある。]
5. 重篤な肝障害のある患者[症状が悪化するおそれがある。]
6. 重篤な腎障害のある患者[症状が悪化するおそれがある。]
7. 重篤な心機能不全のある患者[重篤な副作用(ショック等)が発現した場合、極めて危険な状態にいたるおそれがある。]
8. アスピリン喘息(非ステロイド性消炎鎮痛薬等による喘息発作の誘発)又はその既往歴のある患者[発作を誘発させることがある。]

【組 成 ・ 性 状】

1. 組 成

1 アンプル中に次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
メチロン 注25%	スルピリン水和物(日局) 250mg/1 mL (25w/v%) 500mg/2 mL	ベンジルアルコール 5 mg/mL

2. 製剤の性状

販売名	pH (日本薬局方)	浸透圧比 (生理食塩液対比)	外 観
メチロン 注25%	5.0~8.5	約6	無色~微黄色 澄明の液

【効 能 ・ 効 果】

他の解熱剤では効果が期待できないか、あるいは他の解熱剤の投与が不可能な場合の緊急解熱

【用 法 ・ 用 量】

スルピリン水和物として、通常、成人1回0.25g、症状により最大0.5gを皮下又は筋肉内に注射する。症状の改善が認められない時には1日2回を限度として皮下又は筋肉内に注射する。経口投与、直腸内投与が可能になった場合には速やかに経口投与又は直腸内投与にきりかえること。

長期連用は避けるべきである。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- * 1. 低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児、高齢者、衰弱者に投与する場合には、5%ブドウ糖注射液又は注射用水で適宜希釈し注射すること。

2. 本剤の皮下・筋肉内投与後、神経麻痺又は硬結等をきたすことがあるので、下記のことにご注意すること。なお、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児、高齢者、衰弱者においては、特に注意すること。

- (1) 注射部位については、神経走行部位(特に橈骨神経、尺骨神経、坐骨神経等)を避けて慎重に投与すること。
- (2) くりかえし注射する場合には、同一注射部位を避けること。なお、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児においては連用しないことが望ましい。
- (3) 注射針刺入時、激痛を訴えたり、血液の逆流を見た場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 本人又は両親・兄弟が他の薬物に対するアレルギー、蕁麻疹、アレルギー性鼻炎又は食物アレルギー等の既往歴のある患者
- (2) 消化性潰瘍の既往歴のある患者[消化性潰瘍が再発することがある。]
- (3) 血液の異常又はその既往歴のある患者[血液障害(再生不良性貧血、無顆粒球症等)があらわれるおそれがある。]
- (4) 出血傾向のある患者[血小板機能異常があらわれることがある。]
- (5) 肝障害又はその既往歴のある患者[症状が悪化又は再発するおそれがある。]
- (6) 腎障害又はその既往歴のある患者[症状が悪化又は再発するおそれがある。]
- (7) 心機能異常のある患者[症状が悪化するおそれがある。]
- (8) 過敏症の既往歴のある患者
- (9) 気管支喘息のある患者[喘息発作を誘発するおそれがある。]
- (10) 高齢者(「重要な基本的注意」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 過敏症状等を予測するため、十分な問診を行うこと。
- (2) 本剤による治療は原因療法ではなく対症療法であることに留意すること。
- (3) 患者の状態を十分に観察し、副作用の発現に留意すること。過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等があらわれることがあるので、特に高熱を伴う高齢者及び小児等又は消耗性疾患の患者においては、投与後の患者の状態に十分注意すること。
- (4) 急性疾患に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
 - 1) 発熱の程度を考慮し投与すること。
 - 2) 原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。(原則として5日以内に限りこと。)
 - 3) 原因療法があればこれを行うこと。
- (5) 感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染による炎症に対して用いる場合には適切な抗菌薬を併用し、観察を十分に行い慎重に投与すること。
- (6) 他の解熱鎮痛消炎剤との併用は避けることが望ましい。
- (7) 高齢者及び小児等には副作用の発現に特に注意し、必要最小限の使用にとどめるなど慎重に投与すること。

3. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リチウム	リチウム中毒があらわれるおそれがある。	PG合成抑制によりリチウムの腎排泄が減少し、血中濃度が上昇すると考えられている。
チアジド系利尿薬 トリクロルメチアジド、ヒドロクロチアジド等	これらの薬剤の利尿作用を減弱するおそれがある。	PG合成抑制により、水、塩類の排泄を抑制すると考えられている。

4. 副作用(再審査対象外)

(1) 重大な副作用(頻度不明²⁾)

1) ショック：ショックを起こすことがあるので、観察を十分に行い、胸内苦悶、血圧低下、顔面蒼白、脈拍異常、呼吸困難等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

**2) 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis: TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、剥脱性皮膚炎：これらの副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3) 再生不良性貧血、無顆粒球症：これらの副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4) 黄疸：黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

5) 急性腎不全：急性間質性腎炎等により急性腎不全があらわれることがあるので、乏尿、血尿等の症状及び尿蛋白、BUN・血中クレアチニン上昇、高カリウム血症等の検査所見が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症	発疹・紅斑、浮腫、小疱性角膜炎、結膜炎、そう痒等	
血液		貧血、血小板減少、血小板機能の低下(出血時間の延長)等
肝臓		AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、ALP上昇等
消化器	胃痛、食欲不振、悪心・嘔吐、下痢	
その他	頭痛、倦怠感	

注) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明。

5. 高齢者への投与

高齢者では、副作用があらわれやすいので、少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること(「重要な基本的注意」の項参照)。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠末期に投与したところ、胎児循環持続症(PFC)が起きたとの報告があり、妊娠末期のラットに投与した実験で、弱い胎児の動脈管収縮が報告されている。また、動物実験(マウス)で催奇形作用が報告されている。]

(2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。[ヒト母乳中へ移行することがある。]

7. 小児等への投与

(1) 過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等があらわれることがあるので、投与後の患者の状態に十分注意すること(「重要な基本的注意」の項参照)。

** (2) 低出生体重児、新生児に使用するには十分注意すること。[外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与(99～234mg/kg)により、中毒症状(あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等)が低出生体重児に発現したとの報告がある。本剤は添加物としてベンジルアルコールを含有している。]

8. 適用上の注意

(1) 皮下・筋肉内投与時：皮下・筋肉内投与後、神経麻痺、硬結等をきたすことがあるので注意すること(「用法・用量」に関連する適用上の注意)の項参照)。

(2) 開封時：アンプルカット時の異物混入を避けるため、エタノール消毒綿等で清拭しカットすること。

9. その他の注意

非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

【薬物動態】

血中濃度、代謝

参考(海外データ)

1. 血漿中濃度の推移¹⁾

健康成人にスルピリン水和物1.0gを臀筋内投与した場合、血漿中に未変化体は検出されず、代謝物である4-methylaminoantipyrine(4-MAA)、4-aminoantipyrine(4-AA)、4-acetylaminoantipyrine(4-AcAA)が検出された。これらの最高血漿中濃度は、4-MAAで投与1時間後に12.0±2.3 μg/mL、4-AAで投与4時間後に1.9±0.7 μg/mL、また、4-AcAAで投与8時間後に1.1±0.7 μg/mLであった。

2. 薬物の肝代謝に関与するチトクロームP450分子種²⁾

CYP2B

【薬効薬理】

スルピリン水和物は視床下部の体温調節中枢に作用し、熱放散をきたし解熱効果を示す³⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

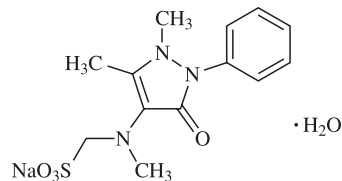
一般名：スルピリン水和物(Sulpyrine Hydrate)
metamizole sodium(INN)

化学名：Monosodium[(1,5-dimethyl-3-oxo-2-phenyl-2,3-dihydro-1H-pyrazol-4-yl)(methyl)amino]methanesulfonate monohydrate

分子式：C₁₃H₁₆N₃NaO₄S・H₂O

分子量：351.35

構造式：



性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。水に極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。光によって着色する。

【取扱い上の注意】

本品は、「ワンポイントカットアンプル」を使用しているため、アンプル枝部のマークを上にして、反対方向に折りとること。

【包装】

メチロン注25% (1 mL) 50アンプル
(2 mL) 50アンプル
(日本薬局方スルピリン注射液)

【主 要 文 献】

- 1) Weiss R, et al. : Arzneimittelforschung 1974 ; 24(3) : 345-348
- 2) Kraul H, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1991 ; 41(5) : 475-480
- 3) 高木博司 : 常用処方薬の薬理(南山堂)1969 : 14-17

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

第一三共株式会社 製品情報センター
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL : 0120-189-132